



VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

10. FEB 2006

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts M/44344-PCT	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014621	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 22.12.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 23.12.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D213/B1, A01N43/40		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 4 Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enhalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 20.10.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 31.01.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Stroeter, T Tel. +49 89 2399-8088 	

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

Beschreibung, Seiten

1-37 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-13 eingegangen am 29.11.2005 mit Schreiben vom 28.11.2005

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/014621

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- | | |
|--------------------------------|---|
| 1. Feststellung | |
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-13
Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-13
Nein: Ansprüche |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-13
Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

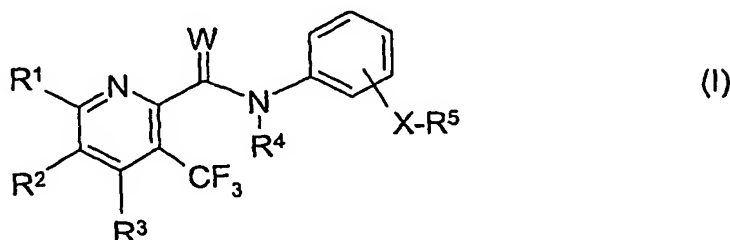
Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- 1 Die vorliegende Anmeldung betrifft 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide welche als Fungizide in der Bekämpfung von Schadpilzen einsetzbar sind. Beansprucht werden solche Verbindungen (unabhängiger Anspruch 1) und ihre Verwendung (unabhängiger Anspruch 11) sowie fungizide Mittel (unabhängiger Anspruch 12) und Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen (unabhängiger Anspruch 13).
- 2 Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:
D1: WO 02/096882 A1 (NIHON NOHYAKU CO., LTD) 5. Dezember 2002
D2: PATENT ABSTRACTS OF JAPAN Bd. 007, Nr. 195 (C-183), 25. August 1983 & JP 58 096069 A (ISHIHARA SANGYO KK), 7. Juni 1983
D3: EP-A-0 545 099 (BASF AKTIENGESellschaft) 9. Juni 1993
D4: WO 03/074491 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG; EHRENFREUND, JOSEF; TOBLER, HANS; WALTER,) 12. September 2003
- 3 Die vorliegenden geänderten Ansprüche sind nun neu im Sinne des Artikels 33(2) PCT gegenüber den vormals überlappenden Ansprüchen 1-3 bzw. 5-7 aus D1, da die Verbindung 3-1 bzw. wie auch alle Verbindungen der genannten Ansprüche aus D1 nicht mehr in den von der vorliegenden Anmeldung beanspruchten Bereich fallen: In D1 sind nur strukturell verwandte Verbindungen offenbart, welche zwei statt einem Substituenten (vorl. Anm.: nur X-R⁵) zusätzlich zur Amidgruppe am Phenylring tragen.
- 4 Durch Einreichung von Vergleichsdaten machte der Anmelder glaubhaft, das Problem verbesserte fungizide 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide im Hinblick auf die strukturell naheliegendsten Fungizide aus D1 bzw. D3 erfolgreich gelöst zu haben. Ein solche verbesserte Wirkung ist im Lichte des relevanten Standes der Technik nicht nahegelegt und daher erscheinen die vorliegenden Ansprüche erfinderisch im Sinne des Art. 33(3) PCT zu sein.

- 5 Die vorliegenden Ansprüche sind gewerblich anwendbar und erfüllen die Erfordernisse des Art. 33(4) PCT.

Patentansprüche

1. 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I,



worin die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- 10 X O, S oder direkte Bindung;
W O oder S;
R¹, R², R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;
15 R⁴ Wasserstoff, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 3 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;
R⁵ unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₃-C₁₂-Alkynyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, wobei die 5
20 letztgenannten Gruppen jeweils 1, 2 oder 3 Substituenten R⁹ aufweisen können, und wobei die Wasserstoffatome in den 5 letztgenannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;
C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₁-C₁₂-Alkyl, das 1, 2 oder 3 Substituenten R¹¹ aufweist,
25 eine Gruppe -C(R¹⁰)=NOR⁸, eine Gruppe -C(O)NR¹³R¹⁴,
Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenyl-C₂-C₆-alkenyl, Phenyl-C₂-C₆-alkynyl, Phenyloxy-C₁-C₆-alkyl, Phenyloxy-C₂-C₆-alkenyl, Phenyloxy-C₂-C₆-alkynyl, wobei der Alkyl-, Alkenyl- und der Alkynyl-Teil in den 6 zuletzt genannten
30 Gruppen 1, 2, 3 oder 4 Substituenten R¹¹ aufweisen kann und der Phenyl-ring in den 7 zuletzt genannten Gruppen 1, 2, 3 oder 4 Reste R⁷ tragen kann;
R⁶ die für R¹ genannten, von Wasserstoff verschiedenen Bedeutungen;
R⁷ C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₂-C₄-Alkynyl, C₂-C₄-Alkynyloxy, wobei die Wasserstoffatome in
35 diesen 7 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein

können, OH, Halogen, Nitro, CN, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, -C(O)R¹², NR¹³R¹⁴, -C(O)NR¹³R¹⁴, -C(S)NR¹³R¹⁴, -C(R¹⁰)=NOR⁸, Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, Phenoxy, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, C₁-C₈-Alkyl-Phenyl, wobei die Wasserstoffatome des Alkylteils teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und der Phenylring 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann,

wobei zwei an benachbarte Kohlenstoffatome gebundene Reste R⁷ auch für CH=CH-CH=CH oder eine Alkylenkette mit 3 bis 5 Gliedern stehen können, worin 1 oder 2 nicht benachbarte CH₂-Gruppen auch durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein können und worin ein Teil oder alle Wasserstoffe durch Halogen ersetzt sein können;

R⁸ C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, wobei die Wasserstoffatome in diesen 4 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können,

Phenyl oder Phenyl-C₁-C₈-alkyl, wobei Phenyl in den zwei letztgenannten Resten 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann;

R⁹ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

R¹⁰ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, wobei die Wasserstoffatome in den 9 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁷ genannten Gruppen aufweisen kann,

R¹¹ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können, oder Halogen;

R¹² Wasserstoff, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₂-C₄-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 7 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

R¹³, R¹⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

2. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, worin R^1 , R^2 und R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl bedeuten.
- 5 3. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, worin R^1 , R^2 und R^3 jeweils für Wasserstoff stehen.
4. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R^4 ausgewählt ist unter Wasserstoff, Methyl, OH oder Methoxy.
- 10 5. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 4, worin R^4 für Wasserstoff steht.
6. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R^5 eine der folgenden Bedeutungen aufweist:
15
 - unsubstituiertes C_4 - C_{12} -Alkyl, C_3 - C_{12} -Cycloalkyl, C_2 - C_{12} -Alkenyl, C_5 - C_{12} -Cycloalkenyl, C_2 - C_{12} -Alkynyl, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und die Wasserstoffatome in C_3 - C_{12} -Cycloalkyl teilweise oder vollständig durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein können,
 - 20 - C_1 - C_{12} -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl;
 - Phenyl, Phenyl- C_1 - C_6 -alkyl, wobei der Phenylring mit 1, 2, 3 oder 4 Resten R^7 substituiert sein kann; oder
 - 25 - $-C(C_1-C_4-Alkyl)=NO-R^8$, wobei die Wasserstoffatome der C_1 - C_4 -Alkylgruppe teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können.
7. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, in denen R^8 die folgenden Bedeutungen aufweist C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, wobei diese Gruppen durch Halogen substituiert sein können, oder Halogen.
- 30 8. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R^1 , R^2 und R^3 jeweils für Wasserstoff stehen und die Gruppe $X-R^5$ in ortho- oder meta-Position zum Amidstickstoff gebunden ist.
- 35 9. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, in denen X eine direkte Bindung oder Sauerstoff bedeutet.

10. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 9, in denen die Gruppe X für Sauerstoff oder eine direkte Bindung steht und R⁵ eine der folgenden Bedeutungen aufweist:
- 5 - unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₂-C₁₂-Alkynyl, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und die Wasserstoffatome in C₃-C₁₂-Cycloalkyl teilweise oder vollständig durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können;
 - 10 - C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl;
 - Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei der Phenylring mit 1, 2, 3 oder 4 Resten R⁷ substituiert sein kann; oder
 - 15 - -C(C₁-C₄-Alkyl)=NO-R⁸, wobei die Wasserstoffatome der C₁-C₄-Alkylgruppe teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können.
11. Verwendung von 3-Trifluormethylpicolinsäureaniliden der allgemeinen Formel I und ihren landwirtschaftlich verträglichen Salzen gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Bekämpfung von Schadpilzen.
- 20 12. Fungizide Mittel, enthaltend eine fungizid wirksame Menge mindestens eines 3-Trifluormethylpicolinsäureanilids der allgemeinen Formel I oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 10.
- 25 13. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Schadpilze, deren Lebensraum oder die von ihnen freizuhaltenden Pflanzen, Flächen, Materialien oder Räume mit mindestens einer fungizid wirksamen Menge eines 3-Trifluormethylpicolinsäureanilids der allgemeinen Formel I oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis
- 30 10 behandelt.